

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 04-243825  
(43)Date of publication of application : 31.08.1992

---

(51)Int.Cl. A61K 31/375  
A61K 31/195

---

(21)Application number : 03-023770 (71)Applicant : SS PHARMACEUT CO LTD  
(22)Date of filing : 25.01.1991 (72)Inventor : KITA FUMIO  
MATSUMOTO KAZUO

---

## (54) REMEDY FOR PIGMENTATION

### (57)Abstract:

**PURPOSE:** To provide the subject medicine capable of effectively curing pigmentation by a short period administration.

**CONSTITUTION:** A medicine for internal use for pigmentation, containing tranexamic acid and ascorbic acid or salts thereof.

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平4-243825

(43)公開日 平成4年(1992)8月31日

(51)Int.Cl. <sup>5</sup> A 61 K 31/375 31/195	識別記号 ADS ADD	府内整理番号 7475-4C 8413-4C	F I	技術表示箇所
---	--------------------	------------------------------	-----	--------

審査請求 未請求 請求項の数1(全4頁)

(21)出願番号 特願平3-23770	(71)出願人 000102496 エスエス製薬株式会社 東京都中央区日本橋浜町2丁目12番4号
(22)出願日 平成3年(1991)1月25日	(72)発明者 北 史男 千葉県八千代市上高野1146-28 (72)発明者 松本 一男 東京都北区中里2-14-4 (74)代理人 弁理士 有賀 三幸 (外2名)

(54)【発明の名称】色素沈着症治療剤

(57)【要約】

【構成】 トランキサム酸及びアスコルビン酸又はその塩を含有する内服薬形態の色素沈着症治療剤。

【効果】 本発明の薬剤を経口投与すれば、短期間の投与で色素沈着症を有効に治療することができる。

1

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 トランキサム酸、及びアスコルビン酸又はその塩を含有する内服薬形態の色素沈着症治療剤。

## 【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は色素沈着症に対して優れた効果を有する内服型の色素沈着症治療剤に関する。

【0002】

【従来の技術】 色素沈着症は、一般に、遺伝的素因、ホルモンの異常、日光の紫外線刺激、光力学的物質等の皮膚刺激、アレルギー性接触皮膚炎の悪化等により、皮膚内にメラニンが異常沈着することによっておこるものと考えられている。このような色素沈着症の治療法としては、従来、ハイドロキノン、ビタミンC誘導体、コウジ酸、トランキサム酸等を含有する外用剤；ビタミンC、L-システィン、グルタチオン、トランキサム酸等を含有する内服剤が提案され、そのうちのあるものは実際に市場に提供されているが、ハイドロキノン製剤以外には、短期間に充分な効果が認められるものはない。しかしながら、ハイドロキノン製剤は副作用が強いために、本邦ではほとんど使用されていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】 従って、本発明は、副作用がなく安定性が高く、短期間の投与で充分な効果が期待できる色素沈着症治療剤を提供することを目的とするものである。

【0004】

【課題を解決するための手段】 斯かる実情において、本発明者は鋭意研究を行った結果、単独の内服でもある程度の治療効果が認められるトランキサム酸に、単独ではあまり効果が認められないアスコルビン酸又はその塩を配合することにより、色素沈着症の治療効果が相乗的に増大し、短期間の投与で優れた効果が得られることを見出し、本発明を完成した。

【0005】 すなわち、本発明は、トランキサム酸、及びアスコルビン酸又はその塩を含有する内服薬形態の色素沈着症治療剤を提供するものである。

【0006】 本発明治療剤の一成分であるトランキサム酸は抗プラスミン剤として用いられているもので、LD<sub>50</sub>が5g/kg以上（イヌの経口）と極めて毒性の低いものである。また、アスコルビン酸もLD<sub>50</sub>が5g/kg以上（イヌの経口）の極めて毒性の低いものである。アスコルビン酸の塩としては、ナトリウム塩、カルシウム塩等が挙げられる。

【0007】 本発明の色素沈着症治療剤は、トランキサム酸、及びアスコルビン酸又はその塩が、共にそれぞれ1日量として、500～1,500mg、特に1,000～1,500mgになるように、1日に1～数回、特に3回に分けて投与するのが好ましい。

【0008】 本発明の色素沈着症治療剤は経口投与の形

10

20

30

40

2

態、例えば顆粒剤、細粒剤、散剤、カプセル剤、錠剤、液剤等の種々の製剤とすることができる。これらの製剤を製造するには、上記必須成分のほかに、かかる場合に一般に使用されている助剤及び他の薬剤等を使用することができ、その製法は自体公知の方法によって行われる。

【0009】

【実施例】 次に実施例を挙げて説明する。

【0010】 実施例1

アスコルビン酸	1000mg
トランキサム酸	1000mg
粉糖	2475mg
軽質無水ケイ酸	25mg

以上の成分から常法によって顆粒剤を製造し、これを3包に分包し、1日分とした。

【0011】 試験例1

下記に示す3種の顆粒剤、すなわち実施例1で調製した薬剤(A)、トランキサム酸単味剤(B)及びアスコルビン酸単味剤(C)を、色素沈着症の1種である肝斑患者（全て女性）に1回1包、1日3回、2ヶ月間経口投与し、投与前後の色素沈着の程度を比較する単純比較臨床試験を行った。（1日量（3包）中）

薬剤	(A)	(B)
(C)		
アスコルビン酸	1000mg	— 1000mg
トランキサム酸	1000mg	1500mg—
粉糖	2475mg	2975mg 3475mg
軽質無水ケイ酸	25mg	25mg 25mg

そのときの、薬剤の投与前後の症状変化は表1〔(A)投与群〕、表2〔(B)投与群〕及び表3〔(C)投与群〕のとおりであり、これに基づいて評価した色素沈着症の改善度は表4に示すとおりである。

【0012】

【表1】

3

薬剤(A)投与群

No.	年令	部 位	改善度
1	39	頬、右ほほ	著明改善
2	39	両ほほ、鼻の下	著明改善
3	45	両ほほ、鼻の下	著明改善
4	41	両ほほ	改 善
5	31	両ほほ	改 善
6	38	両ほほ、まぶた	改 善
7	49	両ほほ、まぶた	改 善
8	40	上口唇	改 善
9	40	額	軽度改善
10	50	右ほほ	改 善
11	50	両ほほ	不 変
12	47	額、両ほほ	軽度改善
13	52	両ほほ	不 変
14	45	額、両ほほ	軽度改善
15	39	両ほほ	軽度改善
16	40	額、両ほほ	改 善
17	43	額、両ほほ	軽度改善
18	30	額、両ほほ	改 善
19	41	顔全面	改 善
20	51	両ほほ	改 善

10

20

薬剤(B)投与群

No.	年令	部 位	改善度
21	45	両ほほ	改 善
22	53	両ほほ	不 変
23	58	額、左ほほ	軽度改善
24	43	額、両ほほ	軽度改善
25	35	額、両ほほ	改 善
26	35	両ほほ	著明改善
27	38	両ほほ	改 善
28	40	両ほほ	改 善
29	50	右ほほ	軽度改善
30	39	額、両ほほ	改 善
31	47	額、両ほほ	不 変
32	45	両ほほ	不 変
33	39	両ほほ	改 善
34	40	額、両ほほ	改 善
35	37	両ほほ	軽度改善
36	30	額	改 善
37	41	顔全面	不 変
38	33	両ほほ	改 善
39	40	両ほほ	改 善
40	37	両ほほ	軽度改善

【0013】

【表2】

【表3】

5

## 薬剤(C)投与群

6

\*【0015】

【表4】

No.	年令	部 位	改善度
41	46	両ほほ	不 変
42	43	両ほほ	不 変
43	38	両ほほ	軽度改善
44	49	額、両ほほ	不 変
45	40	額、両ほほ	不 変
46	37	額	軽度改善
47	35	両ほほ	軽度改善
48	51	顔全面	不 変
49	53	額、両ほほ	不 変
50	46	両ほほ	改 善
51	48	両ほほ	不 変
52	37	右ほほ	不 変
53	33	額	軽度改善
54	39	両ほほ、鼻の下	不 変
55	37	両ほほ	改 善
56	41	両ほほ	不 変
57	38	両ほほ	軽度改善
58	40	左ほほ	不 変
59	42	額、両ほほ	不 変
60	39	額、両ほほ	不 変

10

20

\*

薬 剤	著明改善	改善	軽度改善	不変	悪化	合計	改善率 (%)
(A)	3	10	5	2	0	20	65.0(90.0)
(B)	1	10	5	4	0	20	55.0(80.0)
(C)	0	2	5	13	0	20	10.0(35.0)

( ) 内は軽度改善を含めた場合

【0016】

【発明の効果】本発明の色素沈着症治療剤は副作用がな

く、経口投与によって、短期間に色素沈着症を有効に治療することができる。